

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2002 年 7 月 11 日 (11.07.2002)

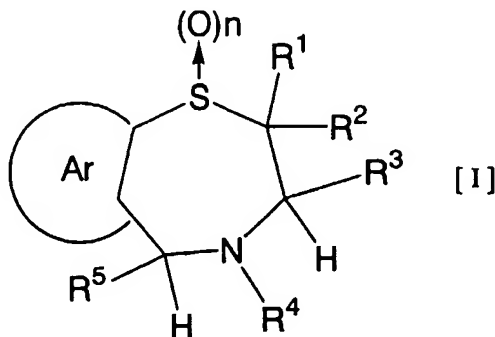
PCT

(10) 国際公開番号
WO 02/053548 A1

- (51) 国際特許分類: C07D 281/10, [JP/JP]; 〒300-2611 茨城県 つくば市 大久保 3 番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP).
417/10, A61K 31/554, A61P 3/10, 3/04
- (21) 国際出願番号: PCT/JP01/11267 (74) 共通の代表者: 萬有製薬株式会社 (BANYU PHARMACEUTICAL CO.,LTD.); 〒103-8416 東京都 中央区 日本橋本町 2 丁目 2 番 3 号 Tokyo (JP).
- (22) 国際出願日: 2001 年 12 月 21 日 (21.12.2001)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願 2000-397400
2000 年 12 月 27 日 (27.12.2000) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 萬有製薬株式会社 (BANYU PHARMACEUTICAL CO.,LTD.) [JP/JP]; 〒103-8416 東京都 中央区 日本橋本町 2 丁目 2 番 3 号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてののみ): 長瀬 敏雄 (NAGASE, Toshio) [JP/JP]; 〒300-2611 茨城県 つくば市 大久保 3 番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP). 佐藤 禎之 (SATO, Yoshiyuki) [JP/JP]; 〒300-2611 茨城県 つくば市 大久保 3 番地 萬有製薬株式会社 つくば研究所内 Ibaraki (JP). 永木 淳一 (EIKI, Junichi)
- (81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SI, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- 添付公開書類:
— 国際調査報告書
- 2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: BENZOTHAIAZEPINE DERIVATIVES

(54) 発明の名称: ベンゾチアゼピン誘導体



(57) Abstract: Compounds represented by the general formula [I]: [I] [wherein R¹ and R² are each hydrogen or C₁₋₃ alkyl; R³ is hydrogen or C₁₋₆ alkyl(except n-butyl); R⁴ is hydrogen, hydroxyl, or C₁₋₃ alkyl; R⁵ is a cyclic, saturated or unsaturated C₃₋₆ aliphatic group, or a linear or branched, saturated or unsaturated C₁₋₉ aliphatic group; Ar is a cyclic, saturated or unsaturated C₃₋₉ aliphatic group, or a linear or branched, saturated or unsaturated C₁₋₉ aliphatic group; and n is an integer of 0 to 2]. The compounds exhibit an activity of bringing about a high blood GLP-1 concentration and are therefore useful as diabetes remedies, preventives for chronic complications of diabetes, antiobestics, and so on.

[続葉有]

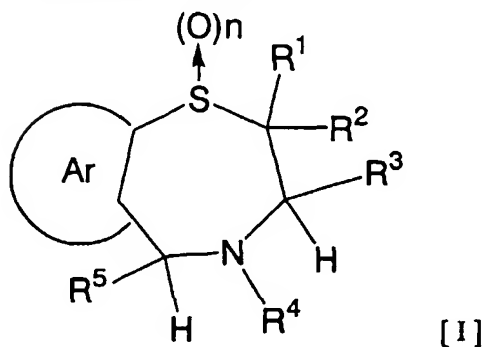


WO 02/053548 A1



(57) 要約:

本発明は、一般式 [I]



[式中、 R^1 及び R^2 は水素原子、 C_1-C_3 アルキル基を； R^3 は水素原子、 C_1-C_6 アルキル基（但し、 n -ブチル基は除く）を； R^4 は水素原子、水酸基、 C_1-C_3 アルキル基を； R^5 は環状の飽和若しくは不飽和の C_3-C_9 脂肪族基、直鎖若しくは分枝鎖の飽和若しくは不飽和の C_1-C_9 脂肪族基を、 Ar は環状の飽和若しくは不飽和の C_3-C_9 脂肪族基、直鎖若しくは分枝鎖の飽和若しくは不飽和の C_1-C_9 脂肪族基を； n は0-2の整数を示す。]で表される化合物に関する。この化合物は、高い血中GLP-1濃度を呈する活性を示していることから、糖尿病治療剤、糖尿病の慢性合併症の予防剤又は抗肥満薬等として有用である。

明 細 書

ベンゾチアゼピン誘導体

5 技 術 分 野

本発明は医薬の分野において有用である。更に詳しくは、本発明化合物のベンゾチアゼピン誘導体は、高い血中GLP-1濃度を呈する活性を示していることから、糖尿病治療剤、糖尿病の慢性合併症の予防剤又は抗肥満薬として有用である。

10

背 景 技 術

健康人の血糖値は、インスリンの作用により、一定にコントロールされている。糖尿病とは、このコントロールが効かなくなり慢性的に高血糖状態を呈すること及びそのことによって引き起こされる疾患をいう。

- 15 糖尿病治療の根本は高血糖状態の是正、すなわち血中グルコース濃度を正常値に戻すことにあるが、近年では特に、空腹時血糖に影響を与えることなく、食後の急激な血糖値の上昇を如何に抑えるかという点が治療上極めて重要であると認識されてきている。

- 現在、臨床現場において使用されている主な糖尿病治療薬は、各種インスリン製剤の他に大別して以下の三種類の治療薬が存在する。第1はスルホニルウレア
- 20 剤に代表されるインスリン放出薬と呼ばれる薬剤群で、この薬剤は膵臓から直接インスリン分泌を促進し血糖値を下げるものである。第2は近年上市されたインスリン抵抗性改善剤と呼ばれるもので、この薬剤は直接インスリン放出を助長することなく、末梢組織での糖の取り込みを促進することにより血糖値を下げる薬
- 25 剤である。第3の α -グルコシダーゼ阻害剤は、消化管における糖質の消化、吸収を遅延し、一時的な食後の血糖値の上昇を抑えることにより、血糖値の急激な上昇を制御する薬である。

一方、グルカゴン様ペプチド-1（以下、GLP-1という。）は、食事の刺

激等によって、小腸腸管上皮に存在する内分泌細胞であるL細胞から分泌されるホルモンであり、膵臓ランゲルハンス島に存在する β 細胞に作用してインスリン分泌を促進することにより血糖を低下させることがわかっている（Eur. J. Clin. Invest、第22巻、第154頁、1992年）。GLP-1によるインスリン分泌作用は、血糖値に依存しており、正常血糖時ではGLP-1によるインスリン分泌は認められず、高血糖時にのみインスリン分泌の亢進が見られることが報告されている（Lancet、第2巻、第1300頁、1987年）。GLP-1はインスリン分泌を亢進するだけでなく、インスリンの生合成を高め（Endocrinology、第130巻、第159頁、1992年）
5 10、また、 β 細胞の増殖を促す（Diabetologia、第42巻、第856頁、1999年）ことから、 β 細胞の維持にとっても欠かすことの出来ない因子である。

一般のII型糖尿病患者へのGLP-1投与によって血中GLP-1濃度を高値に維持した結果、高血糖状態が有意に改善されることが示されており、医療
15 現場においてもその糖尿病に対しての有効性が確認されている（Diabetologia、第36巻、第741頁、1994年又は同、第39巻、第1546頁、1996年）

さらには、GLP-1の作用点は β 細胞だけにとどまらず、末梢組織において糖の利用を亢進することが認められ（Endocrinology、第135巻
20、第2070頁、1994年又はDiabetologia、第37巻、第1163頁、1994年）、また、GLP-1の脳室内投与により摂食抑制作用を示すとの報告がなされている（Digestion、第54巻、第392頁、1993年）。さらに、GLP-1投与により消化管運動抑制作用があることも報告されている（Dig. Dis. Sci.、第43巻、第1113頁、1998年
25）。

本発明の化合物と構造が最も近似する化合物は、特表平7-503724号公報（以下、引例Aという。）、特表平8-506376号公報（以下、引例Bという。）、特表平8-507049号公報（以下、引例Cという。）、特表平10-504035号公報（以下、引例Dという。）、特表平10-279568

号公報（以下、引例Eという。）、国際公開番号WO 00/61568号公報（以下、引例Fという。）、J. Lipid Res.、36、第1106頁、1995年（以下、引例Gという。）、J. Lipid Res.、36、第1098頁、1995年（以下、引例Hという。）、Drug Metab. Dispos.、27、第637頁、1999年（以下、引例Iという。）、Curr. Opin. Cardiovasc. Renal Invest Drugs、1、第276頁、1999年（以下、引例Jという。）、J. Lipid Res.、40、第2158頁、1999年（以下、引例Kという。）、Anal. Biochem.、282、第94頁、2000年（以下、引例Lという。）、国際公開番号WO 00/38725号公報（以下、引例Mという。）、国際公開番号WO 00/38726号公報（以下、引例Nという。）、国際公開番号WO 00/38727号公報（以下、引例Oという。）、国際公開番号WO 00/38728号公報（以下、引例Pという。）、国際公開番号WO 00/38729号公報（以下、引例Qという。）及び国際公開番号WO 00/55355号公報（以下、引例Rという。）に記載されている。

引例AからRには、1、4-ベンゾチアゼピン骨格を有している化合物が記載されている。

しかしながら、本発明の化合物は、1、4-ベンゾチアゼピン1、1-ジオキシド骨格は引例AからRの化合物と共通するものの、該骨格上3位置換基部分が1置換化合物であり、直鎖状 C_1-C_6 、2置換アルキル基を有する、具体的には例えばエチル基、ブチル基などの2置換を有する引例AからRの化合物とは、全く構造が異なる化合物である。

また、引例AからRの用途は、胆汁酸取込阻害作用に起因する血脂減少化合物であり、本発明とは、産業上の利用分野は同じであるが、本発明の用途とは異なる全く関連性のない用途である。また該特許に開示されている化合物が、糖尿病治療薬、糖尿病の慢性合併症の予防剤として有用であることは該特許明細中には開示されていない。

さらに、米国特許第3362962号公報（以下、引例Sという。）には、1、4-ベンゾチアゼピン骨格およびその酸化体、還元体具体的には1、4-ベン

ゾチアゼピン骨格の4、5-ジヒドロ体、4、5-ジヒドロ,N-酸化体および4、5-オキサジリジン体などの化合物などの骨格が記載されている。

しかしながら、本発明の化合物は、1、4-ベンゾチアゼピン骨格は引例Jの化合物と共通するものの、ベンゾチアゼピン骨格の4-ジヒドロ体、4-ジヒドロ,N-酸化体および4、5-オキサジリジン体は、本発明の範囲外で全く構造が異なる化合物である。また、引例Sの用途は、筋弛緩および抗痙攣活性を有する化合物で、産業上の利用分野は同じであるが、本発明の用途とは全く関連性のない用途である。また該特許に開示されている化合物が、糖尿病治療薬、糖尿病の慢性合併症の予防剤として有用であることは該特許明細中には開示されていない。

さらにまた、特開昭53-65895号公報（以下、引例Tという。）には、1、4-ベンゾチアゼピン骨格を含む3環縮合環、ピロール[1,2-d]-1、4-ベンゾチアゼピン骨格を有する化合物が記載されている。

しかしながら、引例Tは3環縮合環であり、本発明の範囲外で、全く構造が異なる化合物である。また、引例Tの用途は、自発運動抑制作用を有する化合物で、産業上の利用分野は同じであるが、本発明の用途とは全く関連性のない用途である。また該特許に開示されている化合物が、糖尿病治療薬、糖尿病の慢性合併症の予防剤として有用であることは該特許明細中には開示されていない。

また、米国特許第5276025号公報（以下、引例Uという。）には、1、4-ベンゾチアゼピン骨格を含むチエノ[3,2-f]-1、4-ベンゾチアゼピン骨格を有する化合物が記載されている。

しかしながら、引例Uは該骨格上5位置換基部分が、水素、直鎖状 C_1-C_5 アルキル基あるいは C_3-C_7 環状アルキル基を有する化合物で、本発明の化合物が置換基を有してもよい芳香環あるいは複素環である点で、全く構造が異なる化合物である。眼圧上昇抑制および緑内障治療薬で、産業上の利用分野は同じであるが、本発明の用途とは全く関連性のない用途である。また該特許に開示されている化合物が、糖尿病治療薬、糖尿病の慢性合併症の予防剤として有用であることは該特許明細中には開示されていない。

現在では、糖尿病治療薬として、例えばスルホニルウレア剤、インスリン抵抗

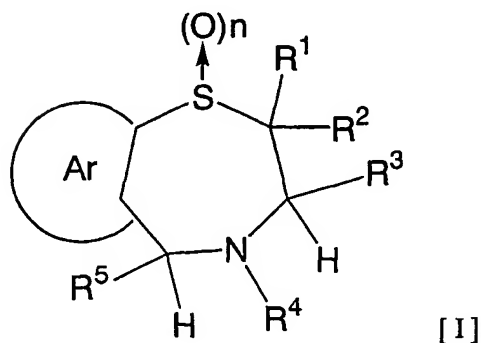
- 性改善剤、 α -グルコシダーゼ阻害剤等の薬剤が臨床で多く用いられているが、以下のような問題点が挙げられ、これらは十分な薬剤であるといえない。すなわち、スルホニルウレア剤は、効果の発現が遅くしかも作用持続時間が長いため、食後の高血糖時に合わせ作用を発現させるのが難しく、さらには空腹時の血糖を
- 5 降下させしばしば生命にかかわるような重篤な低血糖発作を引き起こす場合もある。インスリン抵抗性改善剤は、肝臓に対する副作用がしばしば問題となっており、厳密な管理下における慎重な使用が必要となっている。また浮腫等の副作用を引き起こす場合もある。また、 α -グルコシダーゼ阻害剤には、膨満感や下痢などの副作用が問題となっている。
- 10 したがって、昨今の糖尿病患者の増加に伴い、現在、副作用がなく、血糖値に依存して血糖値を制御できる一層有益な糖尿病治療薬の開発が臨床の現場から求められている。

発 明 の 開 示

- 15 本発明の目的は、高い血中GLP-1濃度を呈する活性を示していることから、糖尿病治療剤、糖尿病の慢性合併症の予防剤又は抗肥満薬等を提供することである。

本発明者らは、血糖値に依存して血糖値を制御できる糖尿病治療薬、糖尿病の慢性合併症の予防剤又は抗肥満薬の創製を目的に鋭意研究を進めてきたところ、

- 20 一般式 [I]



[式中、 R^1 及び R^2 は同一又は異なって、水素原子、 C_1-C_3 アルキル基、 R^3 は水素原子、 C_1-C_6 アルキル基（但し、 n -ブチル基は除く）、

R^4 は水素原子、水酸基、 C_1-C_3 アルキル基、

- R^5 は水素原子、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和若しくは不飽和の C_3-C_9 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、N-アリールスルホニルアミノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、N-アリールスルホニルアミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N-アリールスルホニルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、アリールスルファモイル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、アリールスルファモイル C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-アロイル基、N- (N-アロイルアミノ) C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N-アロイルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 C_2-C_6 アルカノイル基、 C_2-C_6 アルカノイルオキシ基、N- C_2-C_6 アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- C_2-C_6 アルカノイルアミノ基、N- C_1-C_6 アルキルアミノ基、N, N-ジ- C_1-C_6 アルキルアミノ基、N- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、N-アミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボニル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボニルアミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボニルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、N- C_1-C_6 アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- C_1-C_6 アルキルスルファモイル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アミノ C_1-C_6 アルコキシ

カルボニル基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 N, N -ジ- C_3-C_6 シクロアルキルアミノ基、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基、 N, N -ジ- C_3-C_6 シクロアルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基、5又は6員の複素環基、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれる複素原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖若しくは分枝鎖の飽和若しくは不飽和の C_1-C_9 脂肪族基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルチオカルバモイル基からなる群より選ばれる置換基を有してしてもよい炭素芳香環基、1ないし3環性の C_7-C_{15} 炭素芳香環基又は5若しくは6員の複素環基若しくは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれる複素原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基（5又は6員の複素環基を除く。）、

Ar は、水素原子、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和若しくは不飽和の C_3-C_9 脂肪族基、アラルキル基、 N -アラルキルアミノ基、 N, N -ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、 N -アラルキルカルバモイル基、アリール基、 N -アリールアミノ基、 N, N -ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、 N -アリールスルホニルアミノ基、 N -アリールスルホニルアミノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、 N -アリールスルホニルアミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、 N -アリールスルホニルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、アリールスルファモイル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、アリールスルファモイル C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 N -アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、 N -アロイル基、 N -（ N -アロイルアミノ） C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、 N -アロイルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 C_2-C_6 アルカノイル基、 C_2-C_6 アルカノイルオキシ基、 $N-C$

$_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- C_2-C_6 アルカノイルアミノ基、
 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、N, N-ジ- C_1-C_6 アルキルアミノ基、N-
 C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- C_1-C_{10} アルキルカルバモ
 5 イル基、N- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- C_2-C_6 アルケ
 ニルカルバモイル基、N-アミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1
 $-C_6$ アルコキシ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカル
 ボニル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボ
 ニルアミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボ
 ニルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、N- C_1
 10 $-C_6$ アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- C_1-C_6 アルキルスルファモイ
 ル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、 C_1
 $-C_6$ アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アミノ C_1-C_6 アルコ
 キシカルボニル基、N- C_3-C_6 シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- C_3-C_6
 C_6 シクロアルキルアミノ基、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ基、N- C_3-C_6
 15 シクロアルキルカルバモイル基、N, N-ジ- C_3-C_6 シクロアルキルカルバモ
 イル基からなる群から選択される置換基、5又は6員の複素環基、窒素原子、酸
 素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれる複素原子を1環系当たり1ないし5
 個有する1ないし3環性の複素芳香環基又は該置換基で置換されていてもよい、
 直鎖若しくは分枝鎖の飽和若しくは不飽和の C_1-C_9 脂肪族基、 C_1-C_6 アルコ
 20 キシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、N- C_1-C_6 アルキルアミノ基、N- C_1-C_6
 C_6 アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルキルチオカルバモイル基からな
 る群より選ばれる置換基を有していてもよい炭素芳香環基、1ないし3環性の C
 $_7-C_{15}$ 炭素芳香環基又は5若しくは6員の複素環基、若しくは窒素原子、酸素
 原子及び硫黄原子からなる群より選ばれる複素原子を1環系当たり1ないし5個
 25 有する2ないし3環性の縮合複素芳香環基（但し、5若しくは6員の複素環基を
 除く。）、nは0-2の整数を示す。] で表される化合物が生体内において高い
 血中GLP-1濃度を達成することを見出し、本発明を完成した。

本発明は、ベンゾチアゼピン誘導体及びその用途に関するものであり、これら
 の発明は、文献に未記載の新規なものである。

次に本明細書中に記載された各種記号及び用語について説明する。

C_1-C_3 アルキル基とは、例えばメチル基、エチル基、プロピル基等が挙げられ、中でもメチル基、エチル基等が好ましい。

C_1-C_6 アルキル基とは、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロ
5 ピル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、ペンチル基、
ネオペンチル基、ヘキシル基、イソヘキシル基が挙げられ、中でもイソプロピル
基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、ネオペンチル基、イソヘキシル基等が好
ましい。

ハロゲン原子とは、例えばフッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子等
10 が挙げられ、中でもフッ素原子、塩素原子、ヨウ素原子等が好ましく、特にフッ
素原子、塩素原子等がより好ましい。

環状の飽和又は不飽和の C_3-C_9 脂肪族基とは、炭素数3ないし9個よりなる
環状のアルキル基又はアルケニル基等が挙げられ、中でも炭素数3ないし6個な
る環状のアルキル基又はアルケニル基等が好ましく、特に炭素数3ないし6個な
15 る環状のアルキル基等がより好ましい。

該環状のアルキル基とは、例えばシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロ
ペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、シクロオクチル基、シクロ
ノニル基等が挙げられ、中でもシクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペン
チル基、シクロヘキシル基等が好ましい。

20 該環状のアルケニル基とは、例えばシクロプロペニル基、シクロブテニル基、
シクロペンテニル基、シクロヘキセニル基、シクロヘプテニル基、シクロオク
テニル基、シクロノネニル基等が挙げられ、中でもシクロプロペニル基、シクロ
ブテニル基、シクロペンテニル基、シクロヘキセニル基等が好ましい。

アラルキル基とは、炭素数7～15個よりなるアラルキル基を意味し、具体的
25 には例えばベンジル基、 α -メチルベンジル基、フェネチル基、3-フェニルプロ
ピル基、1-ナフチルメチル基、2-ナフチルメチル基、 α -メチル(1-ナ
フチル)メチル基、 α -メチル(2-ナフチル)メチル基、 α -エチル(1-ナ
フチル)メチル基、 α -エチル(2-ナフチル)メチル基、ジフェニルメチル基
等、ジナフチルメチル基等が挙げられ、中でもベンジル基、1-ナフチルメチル

基、2-ナフチルメチル基、 α -メチルベンジル基、フェネチル基等が好ましい。

N-アラルキルアミノ基とは、アミノ基に上記のアラルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばN-ベンジルアミノ基、N-(α -メチルベンジル)アミノ基、N-フェネチルアミノ基、N-(3-フェニルプロピル)アミノ基、N-(1-ナフチルメチル)アミノ基、N-(2-ナフチルメチル)アミノ基、N-[α -メチル(1-ナフチル)メチル]アミノ基、N-[α -メチル(2-ナフチル)メチル]アミノ基、N-[α -エチル(1-ナフチル)メチル]アミノ基、N-[α -エチル(2-ナフチル)メチル]アミノ基、ジフェニルメチルアミノ基、N-(ジナフチルメチル)アミノ基等が挙げられ、中でもN-ベンジルアミノ基、N-(α -メチルベンジル)アミノ基、N-フェネチルアミノ基等が好ましい。

N, N-ジ-アラルキルアミノ基とは、アミノ基に上記のアラルキル基が二置換した基を意味し、具体的には例えばN, N-ジベンジルアミノ基、N, N-ジ(α -メチルベンジル)アミノ基、N, N-ジフェネチルアミノ基、N, N-ジ(3-フェニルプロピル)アミノ基、N, N-ジ(1-ナフチルメチル)アミノ基、N, N-ジ(2-ナフチルメチル)アミノ基、N, N-ジ[α -メチル(1-ナフチル)メチル]アミノ基、N, N-ジ[α -メチル(2-ナフチル)メチル]アミノ基、N-ベンジル-N-(α -メチルベンジル)アミノ基、N-ベンジル-N-フェネチルアミノ基、N-ベンジル-N-(3-フェニルプロピル)アミノ基等が挙げられ、中でもN, N-ジベンジルアミノ基、N, N-ジ(α -メチルベンジル)アミノ基、N, N-ジフェネチルアミノ基等が好ましい。

アラルキルオキシ基とは、酸素原子に上記のアラルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばベンジルオキシ基、 α -メチルベンジルオキシ基、フェネチルオキシ基、3-フェニルプロポキシ基、1-ナフチルメトキシ基、2-ナフチルメトキシ基、 α -メチル(1-ナフチル)メトキシ基、 α -メチル(2-ナフチル)メトキシ基、 α -エチル(1-ナフチル)メトキシ基、 α -エチル(2-ナフチル)メトキシ基、ジフェニルメトキシ基、ジナフチルメトキシ基等が挙げられ、中でもベンジルオキシ基、 α -メチルベンジルオキシ基、フェネチルオ

キシ基等が好ましい。

アラルキルカルボニル基とは、カルボニル基に上記のアラルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばベンジルカルボニル基、 α -メチルベンジルカルボニル基、フェネチルカルボニル基、3-フェニルプロピルカルボニル基、1-
5 ナフチルメチルカルボニル基、2-ナフチルメチルカルボニル基、 α -メチル（1-ナフチル）メチルカルボニル基、 α -メチル（2-ナフチル）メチルカルボニル基、 α -エチル（1-ナフチル）メチルカルボニル基、 α -エチル（2-ナフチル）メチルカルボニル基、ジフェニルメチルカルボニル基、ジナフチルメチルカルボニル基等が挙げられ、中でもベンジルカルボニル基、 α -メチルベンジ
10 ルカルボニル基、フェネチルカルボニル基等が好ましい。

N-アラルキルカルバモイル基とは、カルバモイル基に上記のアラルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばN-ベンジルカルバモイル基、N-（ α -メチルベンジル）カルバモイル基、N-フェネチルカルバモイル基、N-（3-フェニルプロピル）カルバモイル基、N-（1-ナフチルメチル）カルバモイ
15 ル基、N-（2-ナフチルメチル）カルバモイル基、N-（ α -メチル（1-ナフチル）メチル）カルバモイル基、N-（ α -メチル（2-ナフチル）メチル）カルバモイル基、N-（ α -エチル（1-ナフチル）メチル）カルバモイル基、N-（ α -エチル（2-ナフチル）メチル）カルバモイル基、N-（ジフェニルメチル）カルバモイル基、N-（ジナフチルメチル）カルバモイル基等が挙げら
20 れ、特に例えばN-ベンジルカルバモイル基、N-（ α -メチルベンジル）カルバモイル基、N-フェネチルカルバモイル基等が好ましい。

アリール基としては、炭素数6ないし15個よりなるアリール基を意味し、例えばナフチル基、フェニル基等が挙げられ、中でもフェニル基等が好ましい。

N-アリーールアミノ基とは、アミノ基に上記のアリーール基が置換した基を意味
25 し、具体的には例えばN-フェニルアミノ基、N-（1-ナフチル）アミノ基、N-（2-ナフチル）アミノ基等が挙げられ、中でもN-フェニルアミノ基等が好ましい。

N, N-ジアリーールアミノ基とは、アミノ基に上記のアリーール基が二置換した基を意味し、具体的には例えばN, N-ジフェニルアミノ基、N, N-ジ（1-

ナフチル) アミノ基、N, N-ジ(2-ナフチル) アミノ基、N-フェニル-N-(1-ナフチル) アミノ基、N-フェニル-N-(2-ナフチル) アミノ基、N-(1-ナフチル)-N-(2-ナフチル) アミノ基等が挙げられ、中でもN, N-ジフェニルアミノ基、N, N-ジ(1-ナフチル) アミノ基、N, N-ジ(2-ナフチル) アミノ基等が好ましい。

アリールオキシ基とは、酸素原子に上記のアリール基が置換した基を意味し、具体的には例えばフェノキシ基、ナフチルオキシ基等が挙げられ、中でもフェノキシ基等が好ましい。

アリールスルホニル基とは、スルホニル基に上記のアリール基が置換した基を意味し、具体的には例えばフェニルスルホニル基、ナフチルスルホニル基等が挙げられ、中でもフェニルスルホニル基等が好ましい。

アリールスルホニルオキシ基とは、スルホニルオキシ基に上記のアリール基が置換した基を意味し、具体的には例えばフェニルスルホニルオキシ基、ナフチルスルホニルオキシ基等が挙げられ、中でもフェニルスルホニルオキシ基等が好ましい。

N-アリールスルホニルアミノ基とは、アミノ基に上記のアリールスルホニル基がN-置換した基を意味し、具体的には例えばN-フェニルスルホニルアミノ基、N-(1-ナフチルスルホニル) アミノ基、N-(2-ナフチルスルホニル) アミノ基等が挙げられ、中でもN-フェニルスルホニルアミノ基、N-(2-ナフチルスルホニル) アミノ基等が好ましい。

N-アリールスルホニルアミノC₁-C₆アルキルアミノ基とは、アミノ基に上記のアリールスルホニルアミノ基を有するC₁-C₆アルキル基がN-置換した基を意味し、具体的には例えばN-フェニルスルホニルアミノメチルアミノ基、N-(1-フェニルスルホニルアミノエチル) アミノ基、N-(2-フェニルスルホニルアミノエチル) アミノ基、N-ナフチルスルホニルアミノメチルアミノ基、N-(1-ナフチルスルホニルアミノエチル) アミノ基、N-(2-ナフチルスルホニルアミノエチル) アミノ基等が挙げられ、中でもN-フェニルスルホニルアミノメチルアミノ基、N-(2-フェニルスルホニルアミノエチル) アミノ基等が好ましい。

N-アリールスルホニルアミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基とは、カルバモイル基に上記のアリールスルホニルアミノ基を有する C_1-C_6 アルキル基がN-置換した基を意味し、具体的には例えばN-フェニルスルホニルアミノメチルカルバモイル基、N-(1-フェニルスルホニルアミノエチル)カルバモイル基、N-(2-フェニルスルホニルアミノエチル)カルバモイル基、N-ナフチルスルホニルアミノメチルカルバモイル基、N-(1-ナフチルスルホニルアミノエチル)カルバモイル基、N-(2-ナフチルスルホニルアミノエチル)カルバモイル基等が挙げられ、中でもN-フェニルスルホニルアミノメチルカルバモイル基、N-(2-フェニルスルホニルアミノエチル)カルバモイル基、N-(2-ナフチルスルホニルアミノエチル)カルバモイル基等が好ましい。

N-アリールスルホニルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基とは、N-アリールスルホニルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基とは、上記のN-アリールスルホニルアミノ基が C_1-C_6 アルコキシカルボニル基に置換した基を意味し、具体的には例えばN-フェニルスルホニルアミノメトキシカルボニル基、N-ナフチルスルホニルアミノメトキシカルボニル基、1-(N-フェニルスルホニルアミノ)エトキシカルボニル基、2-(N-フェニルスルホニルアミノ)エトキシカルボニル基等が挙げられ、中でもN-フェニルスルホニルアミノメトキシカルボニル基、N-ナフチルスルホニルアミノメトキシカルボニル基等が好ましい。

アリールスルファモイル基とは、スルファモイル基に上記のアリール基が置換した基を意味し、具体的には例えばフェニルスルファモイル基、ナフチルスルファモイル基等が挙げられ、中でもフェニルスルファモイル基等が好ましい。

アリールスルファモイルオキシ基とは、スルファモイルオキシ基に上記のアリール基が置換した基を意味し、具体的には例えばフェニルスルファモイルオキシ基、ナフチルスルファモイルオキシ基等が挙げられ、中でもフェニルスルファモイルオキシ基等が好ましい。

アリールスルファモイル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基とは、上記のアリールスルファモイルが C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基に置換した基を意味し、具体的には例えばフェニルスルファモイルメチルカルバモイル基、ナフチルス

ルファモイルメチルカルバモイル基等が挙げられ、中でもフェニルスルファモイルメチルカルバモイル基等が好ましい。

アリールスルファモイル $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル基とは、上記のアリールスルファモイルが $C_1 - C_6$ アルコキシカルボニル基に置換した基を意味し、具体的には例えばフェニルスルファモイルメトキシカルボニル基、ナフチルスルファモイルメトキシカルボニル基等が挙げられ、中でもフェニルスルファモイルメトキシカルボニル基等が好ましい。

N-アリールカルバモイル基とは、上記のアリール基がカルバモイル基にN-置換した基を意味し、具体的には例えばフェニルカルバモイル基、ナフチルカルバモイル基等が挙げられ、中でもフェニルカルバモイル基等が好ましい。

アロイル基とは、カルボニル基に上記のアリール基が置換した基を意味し、具体的には例えばベンゾイル基、ナフチルカルボニル基等が挙げられ、中でもベンゾイル基等が好ましい。

アロキシ基とは、上記のアロイル基が酸素原子に置換した基を意味し、具体的には例えばベンゾイルオキシ基、ナフチルカルボニルオキシ基等が挙げられ、中でもベンゾイルオキシ基等が好ましい。

N-アロイル基とは、上記のアロイル基が窒素原子に置換した基を意味し、具体的には例えばベンゾイルアミノ基、ナフチルカルボニルアミノ基等が挙げられ、中でもベンゾイルアミノ基等が好ましい。

N-(N-アロイルアミノ) $C_1 - C_{10}$ アルキルカルバモイル基とは、カルバモイル基に上記のN-アロイルアミノ $C_1 - C_{10}$ アルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばN-(N-ベンゾイルアミノメチル)カルバモイル基、N-(1-(N-ベンゾイルアミノ)エチル)カルバモイル基、N-(2-(N-ベンゾイル)アミノエチル)カルバモイル基、N-(N-ナフチルカルボニルアミノメチル)カルバモイル基、N-(1-(N-ナフチルカルボニルアミノ)エチル)カルバモイル基、N-(2-(N-ナフチルカルボニルアミノ)エチル)カルバモイル基等が挙げられ、中でもN-(N-ベンゾイルアミノメチル)カルバモイル基、N-(2-(N-ベンゾイルアミノ)エチル)カルバモイル基等が好ましい。

N-アロイルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基とは、オキシカルボニル基に上記のN-アロイルアミノ C_1-C_6 アルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばN-ベンゾイルアミノメトキシカルボニル基、1-(N-ベンゾイルアミノ) エトキシカルボニル基、2-(N-ベンゾイルアミノ) エトキシカルボニル基、N-ナフチルカルボニルアミノメトキシカルボニル基、1-(N-ナフチルカルボニルアミノ) エトキシカルボニル基、2-(N-ナフチルカルボニルアミノ) エトキシカルボニル基等が挙げられ、中でもN-ベンゾイルアミノメトキシカルボニル基、2-(N-ベンゾイルアミノ) エトキシカルボニル基等が好ましい。

10 C_2-C_6 アルカノイル基とは、カルボニル基に炭素数1ないし5個よりなるアルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばアセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、バレリル基、イソバレリル基、ピバロイル基、ペンタノイル基等が挙げられ、中でもアセチル基、プロピオニル基、ピバロイル基等が好ましい。

15 C_2-C_6 アルカノイルオキシ基とは、水酸基に上記の C_2-C_6 アルカノイル基が置換した基を意味し、具体的には例えばアセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基、ブチリルオキシ基、イソブチリルオキシ基、バレリルオキシ基、イソバレリルオキシ基、ピバロイルオキシ基、ペンタノイルオキシ基等が挙げられ、中でもアセチルオキシ基、プロピオニルオキシ基、ピバロイルオキシ基等が好ましい。

20 N- C_2-C_6 アルカノイルアミノ基とは、アミノ基に上記の C_2-C_6 アルカノイル基が置換した基を意味し、具体的には例えばN-アセチルアミノ基、N-プロピオニルアミノ基、N-ブチリルアミノ基、N-イソブチリルアミノ基、N-バレリルアミノ基、N-イソバレリルアミノ基、N-ピバロイルアミノ基、N-ペンタノイルアミノ基等が挙げられ、中でもN-アセチルアミノ基、N-プロピオニルアミノ基、N-ピバロイルアミノ基等が好ましい。

N, N-ジ- C_2-C_6 アルカノイルアミノ基とは、アミノ基に上記の C_2-C_6 アルカノイル基が二置換した基を意味し、具体的には例えばN, N-ジアセチルアミノ基、N, N-ジプロピオニルアミノ基、N, N-ジブチリルアミノ基、

N, N-ジイソブチルアミノ基、N, N-ジバレリルアミノ基、N, N-ジイソバレリルアミノ基、N, N-ジピバロイルアミノ基、N, N-ジペンタノイルアミノ基、N-アセチル-N-プロピオニルアミノ基、N-アセチル-N-ブチリルアミノ基、N-アセチル-N-ピバロイルアミノ基等が挙げられ、中でもN
 5 , N-ジアセチルアミノ基、N, N-ジプロピオニルアミノ基、N, N-ジイソプロピルアミノ基、N, N-ジブチルアミノ基、N, N-ジピバロイルアミノ基等が好ましい。

N-C₁-C₆アルキルアミノ基とは、アミノ基に炭素数1ないし6個よりなるアルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばN-メチルアミノ基、N-
 10 エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルアミノ基、N-ブチルアミノ基、N-イソブチルアミノ基、N-sec-ブチルアミノ基、N-tert-ブチルアミノ基、N-ペンチルアミノ基、N-ネオペンチルアミノ基、N-ヘキシルアミノ基、N-イソヘキシルアミノ基等が挙げられ、中でもN-メチルアミノ基、N-エチルアミノ基、N-プロピルアミノ基、N-イソプロピルア
 15 ミノ基、N-ブチルアミノ基、N-イソブチルアミノ基、N-tert-ブチルアミノ基等が好ましい。

N, N-ジ-C₁-C₆アルキルアミノ基とは、アミノ基に炭素数1ないし6個よりなるアルキル基が二置換した基を意味し、具体的には例えばN, N-ジメチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、N, N-ジプロピルアミノ基、N,
 20 N-ジイソプロピルアミノ基、N, N-ジブチルアミノ基、N, N-ジtert-ブチルアミノ基、N, N-ジペンチルアミノ基、N, N-ジヘキシルアミノ基、N-エチル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-プロピルアミノ基、N-イソプロピル-N-メチルアミノ基、N-tert-ブチル-N-メチルアミノ基、N-エチル-N-イソプロピルアミノ基等が挙げられ、中でもN, N-ジメチルアミノ基、N, N-ジエチルアミノ基、N, N-ジイソプロピルアミノ基、
 25 N, N-ジブチルアミノ基、N, N-ジtert-ブチルアミノ基、N-エチル-N-メチルアミノ基、N-メチル-N-プロピルアミノ基、N-イソプロピル-N-メチルアミノ基、N-エチル-N-イソプロピルアミノ基等が好ましい。

N-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基とは、カルバモイル基に炭素数1ない

し10個よりなるアルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばN-メチルカルバモイル基、N-エチルカルバモイル基、N-プロピルカルバモイル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-ブチルカルバモイル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-sec-ブチルカルバモイル基、N-tert-ブチルカルバモイル基、N-ペンチルカルバモイル基、N-ネオペンチルカルバモイル基、N-ヘキシルカルバモイル基、N-イソヘキシルカルバモイル基、N-オクチルカルバモイル基、N-デシルカルバモイル基等が挙げられ、中でもN-メチルカルバモイル基、N-エチルカルバモイル基、N-プロピルカルバモイル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-sec-ブチルカルバモイル基、N-tert-ブチルカルバモイル基、N-オクチルカルバモイル基、N-デシルカルバモイル基等が好ましい。

N, N-ジ-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基とは、カルバモイル基に炭素数1ないし10個よりなるアルキル基が二置換した基を意味し、具体的には例えばN, N-ジメチルカルバモイル基、N, N-ジエチルカルバモイル基、N, N-ジプロピルカルバモイル基、N, N-ジイソプロピルカルバモイル基、N, N-ジブチルカルバモイル基、N, N-ジtert-ブチルカルバモイル基、N, N-ジペンチルカルバモイル基、N, N-ジヘキシルカルバモイル基、N-エチル-N-メチルカルバモイル基、N-イソプロピル-N-メチルカルバモイル基、N-tert-ブチル-N-メチルカルバモイル基、N-エチル-N-イソプロピルカルバモイル基等が挙げられ、中でもN, N-ジメチルカルバモイル基、N, N-ジエチルカルバモイル基、N, N-ジイソプロピルカルバモイル基、N, N-ジブチルカルバモイル基、N, N-ジtert-ブチルカルバモイル基、N-エチル-N-メチルカルバモイル基、N-イソプロピル-N-メチルカルバモイル基、N-エチル-N-イソプロピルカルバモイル基等が好ましい。

N-C₂-C₆アルケニルカルバモイル基とは、カルバモイル基に炭素数2ないし6個よりなるアルケニル基が置換した基を意味し、具体的には例えばN-ビニルカルバモイル基、N-アリルカルバモイル基、N-(1-プロペニル)カルバモイル基、N-イソプロペニルカルバモイル基、N-(2-ブテニル)カルバモイル基、N-イソブテニルカルバモイル基、N-(2-ペンテニル)カル

パモイル基、N-(2-ヘキセニル)カルバモイル基、N-(2-ヘプテニル)カルバモイル基、N-(2-オクテニル)カルバモイル基等が挙げられ、中でもN-ビニルカルバモイル基、N-アリルカルバモイル基、N-(1-プロペニル)カルバモイル基等が好ましい。

- 5 N, N-ジ-C₂-C₆アルケニルカルバモイル基とは、カルバモイル基に炭素数2ないし6個よりなるアルケニル基が二置換した基を意味し、具体的には例えばN, N-ジビニルカルバモイル基、N, N-ジアリルカルバモイル基、N, N-ジ(1-プロペニル)カルバモイル基、N, N-ジイソプロペニルカルバモイル基、N-アリル-N-ビニルカルバモイル基、N-アリル-N-イソブテニルカルバモイル基、N-アリル-N-(2-ペンテニル)カルバモイル基、N-アリル-N-(2-ヘキセニル)カルバモイル基、N-アリル-N-(2-ヘプテニル)カルバモイル基、N-アリル-N-(2-オクテニル)カルバモイル基等が挙げられ、中でもN-アリル-N-ビニルカルバモイル基、N, N-ジアリルカルバモイル基、N-アリル-N-(1-プロペニル)カルバモイル基等が好ましい。
- 10
- 15

- N-アミノC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基とは、カルバモイル基に炭素数1ないし10個よりなるアミノアルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばN-アミノメチルカルバモイル基、N-アミノエチルカルバモイル基、N-アミノプロピルカルバモイル基、N-アミノメチルエチルカルバモイル基、N-アミノブチルカルバモイル基、N-アミノプロピルカルバモイル基、N-アミノペンチルカルバモイル基、N-アミノヘキシルカルバモイル基等が挙げられ、中でもN-アミノメチルカルバモイル基、N-アミノエチルカルバモイル基、N-アミノプロピルカルバモイル基、N-アミノメチルエチルカルバモイル基等が好ましい。
- 20

- 25 N-C₁-C₆アルコキシC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基とは、上記のC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基に炭素数1ないし10個よりなるアルコキシ基がN-置換した基を意味し、具体的には例えばN-メトキシメチルカルバモイル基、N-メトキシエチルカルバモイル基、N-メトキシプロピルカルバモイル基、N-メトキシブチルカルバモイル基、N-エトキシペンチルカルバモイル基

、N-ブトキシヘキシルカルバモイル基等が挙げられ、中でもN-メトキシメチルカルバモイル基、N-メトキシエチルカルバモイル基、N-メトキシプロピルカルバモイル基、N-メトキシブチルカルバモイル基等が好ましい。

N-C₁-C₆アルコキシカルボニルC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基とは、
5 上記のC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基に炭素数1ないし6個よりなるアルコキシカルボニル基がN-置換した基を意味し、具体的には例えばN-メトキシカルボニルメチルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルエチルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルプロピルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルブチルカルバモイル基、N-エトキシカルボニルペンチルカルバモイル基、N-ブ
10 トキシカルボニルヘキシルカルバモイル基、N-tert-ブトキシカルボニルエチルカルバモイル基等が挙げられ、中でもN-メトキシカルボニルメチルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルエチルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルプロピルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルブチルカルバモイル基、N-tert-ブトキシカルボニルエチルカルバモイル基等が好ましい。

15 N-C₁-C₆アルコキシカルボニルアミノC₁-C₁₀アルキルカルバモイル基とは、C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基に炭素数1ないし6個よりなるアルコキシカルボニルアミノ基がN-置換した基を意味し、具体的には例えばN-メトキシカルボニルアミノメチルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルアミノエチルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルアミノプロピルカルバモイル基、
20 N-メトキシカルボニルアミノブチルカルバモイル基、N-エトキシカルボニルアミノペンチルカルバモイル基、N-ブトキシカルボニルアミノヘキシルカルバモイル基、N-tert-ブトキシカルボニルアミノエチルカルバモイル基等が挙げられ、中でもN-メトキシカルボニルアミノメチルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルアミノエチルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルアミノ
25 プロピルカルバモイル基、N-メトキシカルボニルアミノブチルカルバモイル基、N-tert-ブトキシカルボニルアミノエチルカルバモイル基等が好ましい。

N-C₁-C₆アルコキシカルボニルアミノC₁-C₆アルコキシカルボニル基とは、C₁-C₆アルコキシカルボニル基に炭素数1ないし6個よりなるアルコキ

シカルボニルアミノ基がN-置換した基を意味し、具体的には例えばN-メトキシカルボニルアミノメトキシカルボニル基、N-メトキシカルボニルアミノエトキシカルボニル基、N-メトキシカルボニルアミノプロポキシカルボニル基、N-メトキシカルボニルアミノブトキシカルボニル基、N-エトキシカルボニルアミノペンチルオキシカルボニル基、N-ブトキシカルボニルアミノヘキシルオキシカルボニル基、N-tert-ブトキシカルボニルアミノエトキシカルボニル基等が挙げられ、中でもN-メトキシカルボニルアミノメトキシカルボニル基、N-メトキシカルボニルアミノエトキシカルボニル基、N-メトキシカルボニルアミノプロポキシカルボニル基、N-メトキシカルボニルアミノブトキシカルボニル基、N-tert-ブトキシカルボニルアミノエトキシカルボニル基等が好ましい。

C₁-C₆アルキルチオ基とは、硫黄原子に炭素数1ないし6個よりなるアルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばメチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、ブチルチオ基、イソブチルチオ基、sec-ブチルチオ基、tert-ブチルチオ基、ペンチルチオ基、ネオペンチルチオ基、ヘキシルチオ基、イソヘキシルチオ基等が挙げられ、中でもメチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、ブチルチオ基、tert-ブチルチオ基等が好ましい。

N-C₁-C₆アルキルスルファモイル基とは、スルファモイル基に炭素数1ないし6個よりなるアルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばN-メチルスルファモイル基、N-エチルスルファモイル基、N-プロピルスルファモイル基、N-イソプロピルスルファモイル基、N-ブチルスルファモイル基、N-イソブチルスルファモイル基、N-sec-ブチルスルファモイル基、N-tert-ブチルスルファモイル基、N-ペンチルスルファモイル基、N-ネオペンチルスルファモイル基、N-ヘキシルスルファモイル基、N-イソヘキシルスルファモイル基等が挙げられ、中でもN-メチルスルファモイル基、N-エチルスルファモイル基、N-イソプロピルスルファモイル基、N-tert-ブチルスルファモイル基等が好ましい。

N, N-ジ-C₁-C₆アルキルスルファモイル基とは、スルファモイル基に

炭素数 1 ないし 6 個よりなるアルキル基が二置換した基を意味し、具体的には例えば N, N-ジメチルスルファモイル基、N, N-ジエチルスルファモイル基、N, N-ジプロピルスルファモイル基、N, N-ジイソプロピルスルファモイル基、N, N-ジブチルスルファモイル基、N, N-ジtert-ブチルスルファモイル基、N, N-ジペンチルスルファモイル基、N, N-ジヘキシルスルファモイル基、N-エチル-N-メチルスルファモイル基、N-イソプロピル-N-メチルスルファモイル基、N-tert-ブチル-N-メチルスルファモイル基、N-エチル-N-イソプロピルスルファモイル基等が挙げられ、中でも N, N-ジメチルスルファモイル基、N, N-ジエチルスルファモイル基、N, N-ジイソプロピルスルファモイル基、N, N-ジブチルスルファモイル基、N, N-ジtert-ブチルスルファモイル基、N-エチル-N-メチルスルファモイル基、N-イソプロピル-N-メチルスルファモイル基、N-エチル-N-イソプロピルスルファモイル基等が好ましい。

C₁-C₆アルキルスルフィニル基とは、スルフィニル基に炭素数 1 ないし 6 個よりなるアルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばメチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、プロピルスルフィニル基、イソプロピルスルフィニル基、ブチルスルフィニル基、イソブチルスルフィニル基、sec-ブチルスルフィニル基、tert-ブチルスルフィニル基、ペンチルスルフィニル基、ネオペンチルスルフィニル基、ヘキシルスルフィニル基、イソヘキシルスルフィニル基等が挙げられ、中でもメチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、プロピルスルフィニル基、イソプロピルスルフィニル基、ブチルスルフィニル基、tert-ブチルスルフィニル基等が好ましい。

C₁-C₆アルキルスルホニル基とは、スルホニル基に炭素数 1 ないし 6 個よりなるアルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばメチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基、ブチルスルホニル基、イソブチルスルホニル基、sec-ブチルスルホニル基、tert-ブチルスルホニル基、ペンチルスルホニル基、ネオペンチルスルホニル基、ヘキシルスルホニル基、イソヘキシルスルホニル基等が挙げられ、中でもメチルスルホニル基、エチルスルホニル基、プロピルスルホニル基、ブチルスルホニル基等が好ましい。

ル基、*tert*-ブチルスルホニル基等が好ましい。

C_1-C_6 アルコキシ基とは、酸素原子に炭素数 1 ないし 6 個よりなるアルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、*sec*-ブトキシ基、
5 *tert*-ブトキシ基、ペンチルオキシ基、ネオペンチルオキシ基、ヘキシルオキシ基、イソヘキシルオキシ基等が挙げられ、中でもメトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、ブトキシ基、イソブトキシ基、*tert*-ブトキシ基等が好ましい。

C_1-C_6 アルコキシカルボニル基とは、カルボニル基に炭素数 1 ないし 5 個よりなるアルコキシ基が置換した基を意味し、具体的には例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、ブトキシカルボニル基、イソブトキシカルボニル基、*sec*-ブトキシカルボニル基、*tert*-ブトキシカルボニル基、ペンチルオキシカルボニル基、ネオペンチルオキシカルボニル基等が挙げられ、中でもメトキシカルボニル基、
10 エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、ブトキシカルボニル基、*tert*-ブトキシカルボニル基等が好ましい。

アミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基とは、カルボニル基に炭素数 1 ないし 6 個よりなるアミノアルコキシ基が置換した基を意味し、具体的には例えばアミノメトキシカルボニル基、アミノエトキシカルボニル基、アミノプロポキシカルボニル基、2-アミノ-2-メチルプロポキシカルボニル基、2-アミノメチルエトキシカルボニル基、アミノブトキシカルボニル基、2-アミノプロポキシカルボニル基、アミノペンチルオキシカルボニル基、アミノヘキシルオキシカルボニル基等が挙げられ、中でもアミノメトキシカルボニル基、アミノエトキシカルボニル基、アミノプロポキシカルボニル基、2-アミノメチルエトキシカルボニル基、2-アミノ-2-メチルプロポキシカルボニル基等が好ましい。
20
25

$N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基とは、アミノ基に炭素数 3 ないし 6 個なる環状のアルキル基がN-置換した基を意味し、具体的には例えばN-シクロプロピルアミノ基、N-シクロブチルアミノ基、N-シクロペンチルアミノ基、N-シクロヘキシルアミノ基等が挙げられ、中でもN-シクロプロピルアミノ基

、 N-シクロペンチルアミノ基、 N-シクロヘキシルアミノ基等が好ましい。

N, N-ジ- C₃-C₆シクロアルキルアミノ基とは、アミノ基に炭素数3ないし6個なる環状のアルキル基が二置換した基を意味し、具体的には例えばN, N-ジシクロプロピルアミノ基、N, N-ジシクロブチルアミノ基、N, N-ジシクロペンチルアミノ基、N, N-ジシクロヘキシルアミノ基、N-シクロブチル-N-シクロプロピルアミノ基、N-シクロペンチル-N-シクロプロピルアミノ基、N-シクロヘキシル-N-シクロプロピルアミノ基等が挙げられ、中でもN, N-ジシクロプロピルアミノ基、N, N-ジシクロブチルアミノ基、N, N-ジシクロペンチルアミノ基等が好ましい。

- 10 C₃-C₆シクロアルキルオキシ基とは、酸素原子に炭素数3ないし6個なる環状のアルキル基が置換した基を意味し、例えばN-シクロプロポキシ基、N-シクロブトキシ基、N-シクロペンチルオキシ基、N-シクロヘキシルオキシ基等が挙げられ、中でもN-シクロプロポキシ基、N-シクロペンチルオキシ基、N-シクロヘキシルオキシ基等が好ましい。

- 15 N-C₃-C₆シクロアルキルカルバモイル基とは、カルバモイル基に炭素数3ないし6個なる環状のアルキル基が置換した基を意味し、例えばN-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロブチルカルバモイル基、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基等が挙げられ、中でもN-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロペンチルカルバモイル基、N-シクロヘキシルカルバモイル基等が好ましい。
- 20

- N, N-ジ- C₃-C₆シクロアルキルカルバモイル基とは、カルバモイル基に炭素数3ないし6個なる環状のアルキル基が二置換した基を意味し、具体的には例えばN, N-ジシクロプロピルカルバモイル基、N, N-ジシクロブチルカルバモイル基、N, N-ジシクロペンチルカルバモイル基、N, N-ジシクロヘキシルカルバモイル基、N-シクロブチル-N-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロペンチル-N-シクロプロピルカルバモイル基、N-シクロヘキシル-N-シクロプロピルカルバモイル基等が挙げられ、中でもN, N-ジシクロプロピルカルバモイル基、N, N-ジシクロブチルカルバモイル基、N, N-ジシクロペンチルカルバモイル基等が好ましい。
- 25

5 又は6員の複素環基とは、例えばイソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアジニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、フラザニル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基、モルホリノ基等が挙げられ、中でもイソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、テトラヒドロフラニル基、モルホリノ基等が好ましい。

窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれる複素原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基とは、例えばアクリジニル基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリジニル基、キノリル基、クマロニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、フェノチアジニル基、フタラジニル基、プテリジニル基、プリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基、メチレンジオキシフェニル基等が挙げられ、中でもエチレンジオキシフェニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、メチレンジオキシフェニル基等が好ましい。

25 直鎖若しくは分枝鎖の飽和又は不飽和の $C_1 - C_9$ 脂肪族基とは、炭素数1ないし9個よりなる直鎖状又は分枝状のアルキル基、アルケニル基又はアルキニル基が挙げられ、中でも炭素数1ないし6個なる直鎖状又は分枝状のアルキル基、アルケニル基又はアルキニル基が好ましい。

該アルキル基とは、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基

、ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、ネオペンチル基、ヘキシル基、イソヘキシル基、ヘプチル基、オクチル基、ノニル基等が挙げられ、中でもメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基等が好ましい。

- 5 該アルケニル基とは、例えばビニル基、アリル基、1-プロペニル基、イソプロペニル基、2-ブテニル基、イソブテニル基、2-ペンテニル基、2-ヘキセニル基、2-ヘプテニル基、2-オクテニル基等が挙げられ、中でもビニル基、アリル基、1-プロペニル基等が好ましい。

- 該アルキニル基とは、例えばエチニル基、1-プロピニル基、1-ブテニル基
10 、1-ペンテニル基、1-ヘキシニル基、1-ヘプチニル基、1-オクチニル基等が挙げられ、中でもエチニル基、1-プロピニル基等が好ましい。

- N-C₁-C₁₀アルキルカルバモイル基とは、カルバモイル基に炭素数1ないし10個よりなるアルキル基が置換した基を意味し、具体的には例えばN-メチルカルバモイル基、N-エチルカルバモイル基、N-プロピルカルバモイル基、
15 N-イソプロピルカルバモイル基、N-ブチルカルバモイル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-sec-ブチルカルバモイル基、N-tert-ブチルカルバモイル基、N-ペンチルカルバモイル基、N-ネオペンチルカルバモイル基、N-ヘキシルカルバモイル基、N-イソヘキシルカルバモイル基、N-オクチルカルバモイル基、N-デシルカルバモイル基等が挙げられ、中でもN-メチル
20 カルバモイル基、N-エチルカルバモイル基、N-プロピルカルバモイル基、N-イソプロピルカルバモイル基、N-イソブチルカルバモイル基、N-sec-ブチルカルバモイル基、N-tert-ブチルカルバモイル基、N-オクチルカルバモイル基、N-デシルカルバモイル基等が好ましい。

- N-C₁-C₁₀アルキルチオカルバモイル基とは、チオカルバモイル基に炭素
25 数1ないし10個よりなるアルキル基がN-置換した基を意味し、具体的には例えばN-メチルチオカルバモイル基、N-エチルチオカルバモイル基、N-プロピルチオカルバモイル基、N-イソプロピルチオカルバモイル基、N-ブチルチオカルバモイル基、N-イソブチルチオカルバモイル基、N-sec-ブチルチオカルバモイル基、N-tert-ブチルチオカルバモイル基、N-ペンチルチ

オカルバモイル基、N-ネオペンチルチオカルバモイル基、N-ヘキシルチオカルバモイル基、N-イソヘキシルチオカルバモイル基、N-オクチルチオカルバモイル基、N-デシルチオカルバモイル基等が挙げられ、中でもN-メチルチオカルバモイル基、N-エチルチオカルバモイル基、N-プロピルチオカルバモイル基、N-イソプロピルチオカルバモイル基、N-イソブチルチオカルバモイル基、N-sec-ブチルチオカルバモイル基、N-tert-ブチルチオカルバモイル基、N-オクチルチオカルバモイル基、N-デシルチオカルバモイル基等が好ましい。

1ないし3環性のC₇-C₁₅炭素芳香環基とは、上記のアリール基を除く、例えばアセナフチレニル基、アダマンチル基、アンスリル基、インデニル基、ノルボルニル基、フェナンスリル基等が挙げられ、中でもアンスリル基、フェナンスリル基等が好ましい。

窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれる複素原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の縮合複素芳香環基（但し、5若しくは6員の複素環基を除く。）とは、例えばアクリジニル基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリル基、クマロニル基、イソクロマニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリジニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、フェノチアジニル基、フタラジニル基、プテリジニル基、プリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基、ジヒドロベンゾフラニル基、メチレンジオキシフェニル基等が挙げられ、中でもエチレンジオキシフェニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、メチレンジオキシフェニル基等が好ましい。

R¹及びR²は、同一又は異なって、例えば水素原子、C₁-C₃アルキル基を示し、中でも水素原子が好適である。

R³は、例えば水素原子、C₁-C₆アルキル基（但し、n-ブチル基は除く）を示し、中でもC₂-C₆アルキル基（但し、n-ブチル基は除く）が好適であり

、特に例えば C_3-C_5 の分岐したアルキル基が好適である。

R^4 は、例えば水素原子、水酸基、 C_1-C_3 アルキル基を示し、中でも水素原子、 C_1-C_3 アルキル基が好適であり、特に例えば水素原子が好適である。

R^5 は、例えば水素原子、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和若しくは不飽和の C_3-C_9 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、N-アリールスルホニルアミノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、N-アリールスルホニルアミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N-アリールスルホニルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、アリールスルファモイル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、アリールスルファモイル C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-アロイル基、N-（N-アロイルアミノ） C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N-アロイルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 C_2-C_6 アルカノイル基、 C_2-C_6 アルカノイルオキシ基、N- C_2-C_6 アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- C_2-C_6 アルカノイルアミノ基、N- C_1-C_6 アルキルアミノ基、N, N-ジ- C_1-C_6 アルキルアミノ基、N- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、N-アミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボニル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボニルアミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボニルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、N- C_1-C_6 アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- C_1-C_6 アルキルスルファ

- モイル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 N, N -ジ- C_3-C_6 シクロアルキルアミノ基、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ基、 $N-C_3$ - C_6 シクロアルキルカルバモイル基、 N, N -ジ- C_3-C_6 シクロアルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基、5又は6員の複素環基、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれる複素原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基並びに該置換基で置換されていて
- もよい、直鎖若しくは分枝鎖の飽和若しくは不飽和の C_1-C_9 脂肪族基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルチオカルバモイル基からなる群より選ばれる置換基を有してしてもよい炭素芳香環基、1ないし3環性の C_7-C_{16} 炭素芳香環基又は5若しくは6員の複素環基若しくは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれる複素原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基（5又は6員の複素環基を除く。）
- を示し、中でも炭素芳香環基が、フェニル基、ナフチル基であり、置換基を有していてもよい炭素芳香環基の置換基が、水素原子、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、環状の飽和若しくは不飽和の C_3-C_9 脂肪族基、アラルキル基、 N -アラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、 N -アラルキルカルバモイル基、アリール基、 N -アリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、 N -アリールスルホニルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、アリールスルファモイル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、アリールスルファモイル C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 N -アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、 N -アロイル基、 C_2-C_6 アルカノイル基、 C_2-C_6 アルカノイルオキシ基、 $N-C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、 N, N -ジ- C_2-C_6 アルカノイルアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバ

モイル基、N, N-ジ- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、N-アミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボニル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、N- C_3-C_6 シクロアルキルアミノ基、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ基、N- C_3-C_6 シクロアルキルカルバモイル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基、モルホリノ基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、アクリジニル基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリル基、クロマニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基、ジヒドロベンゾフラニル基、メチレンジオキシフェニル基であり、1ないし3環性の C_7-C_{15} 炭素芳香環基が、アセナフチレニル基、アダマンチル基、アンスリル基、インデニル基、フェナンスリル基であり、5若しくは6員の複素環基が、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基であり、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれる複素原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基（5又は6員の複素環基を除く。）が、アクリジニル基、イソキ

- ノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリル基、クロマニル基、イソクロマニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリジニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、チオナフテニル基、ナフチジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、フェノチアジニル基、フタラジニル基、プテリジニル基、プリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基、ジヒドロベンゾフラニル基若しくはメチレンジオキシフェニル基が好適であり、特に炭素芳香環基が、フェニル基、ナフチル基であり、置換基を有していてもよい炭素芳香環基の置換基が、水素原子、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシ基、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、アリールスルファモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-アロイル基、 C_2-C_6 アルカノイル基、 C_2-C_6 アルカノイルオキシ基、N- C_2-C_6 アルカノイルアミノ基、N- C_1-C_6 アルキルアミノ基、N- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、N-アミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボニル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、N- C_3-C_6 シクロアルキルアミノ基、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジニル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、フリル基、テトラヒドロフラニル基、モルホリノ基、イソキノリル基、イソインドリル基、エチレンジオキシフェニル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベ

- ンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾフラニル基、メチレンジオキシフェニル基であり、1ないし3環性の C_7-C_{15} 炭素芳香環基が、アセナフチレニル基、インデニル基、フェナンスリル基であり、5若しくは6員の複素環基が、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、
- 5 チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、フリル基であり、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれる複素原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基（5又は6員の複素環基を除く。）が、イソキノリル基、イソインドリル基、エチレンジオキシフェニル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、ジベンゾフラニル基、ジ
- 10 ベンゾチオフェニル基、フェナキサジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾフラニル基、ジヒドロベンゾフラニル基若しくはメチレンジオキシフェニル基がより好適である。

- A r は、例えば水素原子、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、シアノ基、スルファモイル
- 15 ル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和若しくは不飽和の C_3-C_9 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールス
- 20 ルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、N-アリールスルホニルアミノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、N-アリールスルホニルアミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N-アリールスルホニルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、アリールスルファモイル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基
- 25 、アリールスルファモイル C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-アロイル基、N-（N-アロイルアミノ） C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N-アロイルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 C_2-C_6 アルカノイル基、 C_2-C_6 アルカノイルオキシ基、N- C_2-C_6 アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- C_2-C_6 アルカノイルアミ

ノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 N, N -ジ- C_1-C_6 アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキルカルバモイル基、 N, N -ジ- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、 $N-C_2-C_6$ アルケニルカルバモイル基、 N, N -ジ- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、 N -アミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、 N - C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_6$ アルコキシカルボニル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_6$ アルコキシカルボニルアミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_6$ アルコキシカルボニルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルスルファモイル基、 N, N -ジ- C_1-C_6 アルキルスルファモイル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 N, N -ジ- C_3-C_6 シクロアルキルアミノ基、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基、 N, N -ジ- C_3-C_6 シクロアルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基、5又は6員の複素環基、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれる複素原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖若しくは分枝鎖の飽和若しくは不飽和の C_1-C_9 脂肪族基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルチオカルバモイル基からなる群より選ばれる置換基を有していてもよい炭素芳香環基、1ないし3環性の C_7-C_{15} 炭素芳香環基又は5若しくは6員の複素環基、若しくは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれる複素原子を1環系当たり1ないし5個有する2ないし3環性の縮合複素芳香環基（但し、5若しくは6員の複素環基を除く。）を示し、中でも炭素芳香環基が、フェニル基、ナフチル基であり、置換基を有していてもよい炭素芳香環基の置換基が、水素原子、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、環状の飽和若しくは不飽和の C_3-C_9 脂肪族基、アラルキル基、 N -アラルキルアミノ基、アラ

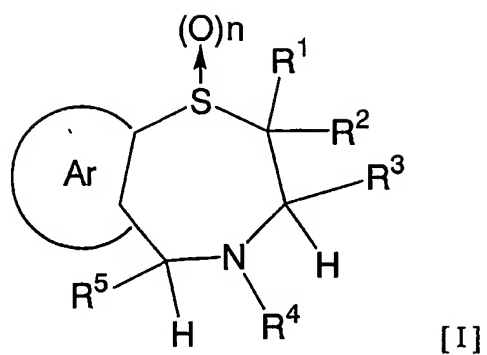
- ルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、
- 5 、アリールスルファモイル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、アリールスルファモイル C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-アロイル基、 C_2-C_6 アルカノイル基、 C_2-C_6 アルカノイルオキシ基、N- C_2-C_6 アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- C_2-C_6 アルカノイルアミノ基、N- C_1-C_6 アルキルアミノ基、N- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、N-アミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボニル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、N- C_3-C_6 シクロアルキルアミノ基、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ基、N- C_3-C_6 シクロアルキルカルバモイル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基、モルホリノ
- 10 ル基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジニル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、アクリジニル基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリル基、クロマニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、
- 15
- 20
- 25

ベンゾフラニル基、ジヒドロベンゾフラニル基、メチレンジオキシフェニル基で
 あり、1ないし3環性の C_7-C_{15} 炭素芳香環基が、アセナフチレニル基、アダ
 マンチル基、アンスリル基、インデニル基、フェナンスリル基であり、5若しく
 は6員の複素環基が、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基
 5、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、ピリジル基
 、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基
 、ピラニル基、フリル基であり、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群よ
 り選ばれる複素原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の縮合複
 素芳香環基（5若しくは6員の複素環基を除く。）が、アクリジニル基、イソキ
 10ノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル
 基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサ
 リニル基、キノリル基、クロマニル基、イソクロマニル基、クロメニル基、フェ
 ナンスリジニル基、フェナンスロリジニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオ
 フェニル基、チオナフテニル基、ナフチジニル基、フェナジニル基、フェナキサ
 15ジニル基、フェノチアジニル基、フタラジニル基、プテリジニル基、プリニル基
 、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾ
 トリアゾリル基、ベンゾフラニル基、ジヒドロベンゾフラニル基若しくはメチレ
 ンジオキシフェニル基が好適であり、特に炭素芳香環基が、フェニル基、ナフチ
 ル基であり、置換基を有していてもよい炭素芳香環基の置換基が、水素原子、ア
 20ジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルボキシル基、シアノ基、ニトロ基、ハ
 ロゲン原子、ヒドロキシ基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、アラルキ
 ルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリー
 ル基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基
 、アリールスルファモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-アロイル基、 C_2
 25- C_6 アルカノイル基、 C_2-C_6 アルカノイルオキシ基、N- C_2-C_6 アルカノ
 イルアミノ基、N- C_1-C_6 アルキルアミノ基、N- C_1-C_{10} アルキルカルバ
 モイル基、N, N-ジ- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_2-C_6 アル
 ケニルカルバモイル基、N, N-ジ- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、N-
 アミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_{10}

アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_6$ アルコキシカルボニル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、フリル基、テトラヒドロフラニル基、モルホリノ基、イソキノリル基、イソインドリル基、エチレンジオキシフェニル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾフラニル基、メチレンジオキシフェニル基であり、1ないし3環性の C_7-C_{15} 炭素芳香環基が、アセナフチレニル基、インデニル基、フェナンスリル基であり、5若しくは6員の複素環基が、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、フリル基であり、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれる複素原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基（5又は6員の複素環基を除く。）が、イソキノリル基、イソインドリル基、エチレンジオキシフェニル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、フェナキサジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾフラニル基、ジヒドロベンゾフラニル基若しくはメチレンジオキシフェニル基がより好適である。

n は、0-2の整数を示し、中でも0又は2が好適であり、特に、2がより好適である。

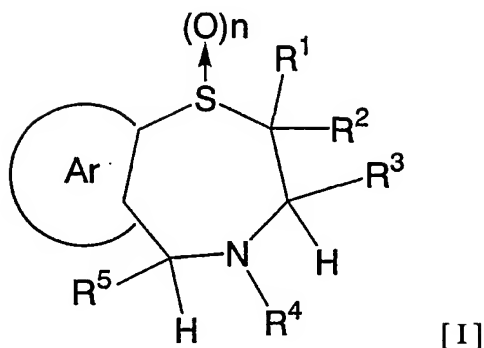
本発明の一般式[I]



[式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵及びArは前記の意味を有する。]で表される化合物の代表例を表1から表15に示す。

請 求 の 範 囲

1. 一般式[I]



[式中、 R^1 及び R^2 は同一又は異なって、水素原子、 C_1-C_3 アルキル基、

5 R^3 は水素原子、 C_1-C_6 アルキル基（但し、 n -ブチル基は除く）、

R^4 は水素原子、水酸基、 C_1-C_3 アルキル基、

R^5 は水素原子、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシ基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ

10 基、環状の飽和若しくは不飽和の C_3-C_9 脂肪族基、アラルキル基、 N -アラルキルアミノ基、 N 、 N -ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、 N -アラルキルカルバモイル基、アリール基、 N -アリールアミノ基、 N 、 N -ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、 N -アリールスルホニルアミノ基、 N -アリ

15 ールスルホニルアミノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、 N -アリールスルホニルアミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、 N -アリールスルホニルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、アリールスルファモイル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、アリールスルファモイル C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 N -アリールカルバモイル

20 基、アロイル基、アロキシ基、 N -アロイル基、 N -（ N -アロイルアミノ） C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、 N -アロイルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 C_2-C_6 アルカノイル基、 C_2-C_6 アルカノイルオキシ基、 $N-C_2$

- $-C_6$ アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- C_2-C_6 アルカノイルアミノ基、N- C_1-C_6 アルキルアミノ基、N, N-ジ- C_1-C_6 アルキルアミノ基、N- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、N-アミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボニル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボニルアミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボニルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、N- C_1-C_6 アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- C_1-C_6 アルキルスルファモイル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、N- C_3-C_6 シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- C_3-C_6 シクロアルキルアミノ基、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ基、N- C_3-C_6 シクロアルキルカルバモイル基、N, N-ジ- C_3-C_6 シクロアルキルカルバモイル基からなる群から選択される置換基、5又は6員の複素環基、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれる複素原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基並びに該置換基で置換されていてもよい、直鎖若しくは分枝鎖の飽和若しくは不飽和の C_1-C_9 脂肪族基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、N- C_1-C_6 アルキルアミノ基、N- C_1-C_6 アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルキルチオカルバモイル基からなる群より選ばれる置換基を有してしてもよい炭素芳香環基、1ないし3環性の C_7-C_{15} 炭素芳香環基又は5若しくは6員の複素環基若しくは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれる複素原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基（5又は6員の複素環基を除く。）、

Arは、水素原子、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、シアノ基、スルファモイル基、スルホ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ホルミル基、ホルミルアミノ基、環状の飽和若しくは不飽和の C_3-C_9 脂肪族基、アラルキル基、N-アラ

- ルキルアミノ基、N, N-ジアラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラル
 キルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリール
 アミノ基、N, N-ジアリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニ
 ル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ基、N-ア
 5 リールスルホニルアミノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、N-アリールスルホニルア
 ミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N-アリールスルホニルアミノ C_1-C
 $_6$ アルコキシカルボニル基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイ
 ルオキシ基、アリールスルファモイル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、アリ
 ールスルファモイル C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、N-アリールカルバモイ
 10 ル基、アロイル基、アロキシ基、N-アロイル基、N- (N-アロイルアミノ)
 C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N-アロイルアミノ C_1-C_6 アルコキシカ
 ルボニル基、 C_2-C_6 アルカノイル基、 C_2-C_6 アルカノイルオキシ基、N- C
 $_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、 N, N-ジ- C_2-C_6 アルカノイルアミノ基、
 N- C_1-C_6 アルキルアミノ基、N, N-ジ- C_1-C_6 アルキルアミノ基、N-
 15 C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- C_1-C_{10} アルキルカルバモ
 イル基、N- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- C_2-C_6 アルケ
 ニルカルバモイル基、N-アミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1
 $-C_6$ アルコキシ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカ
 ルボニル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボニ
 20 ルアミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボニ
 ルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、N- C_1
 $-C_6$ アルキルスルファモイル基、N, N-ジ- C_1-C_6 アルキルスルファモイ
 ル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、 C_1
 $-C_6$ アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 アミノ C_1-C_6 アルコ
 25 キシカルボニル基、N- C_3-C_6 シクロアルキルアミノ基、N, N-ジ- C_3-C
 $_6$ シクロアルキルアミノ基、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ基、N- C_3-C_6
 シクロアルキルカルバモイル基、N, N-ジ- C_3-C_6 シクロアルキルカルバモ
 イル基からなる群から選択される置換基、5又は6員の複素環基、窒素原子、酸
 素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれる複素原子を1環系当たり1ないし5

個有する 1 ないし 3 環性の複素芳香環基又は該置換基で置換されていてもよい、直鎖若しくは分枝鎖の飽和若しくは不飽和の C_1-C_9 脂肪族基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルカルバモイル基、 $N-C_1-C_6$ アルキルチオカルバモイル基からなる群より選ばれる置換基を有していてもよい炭素芳香環基、1 ないし 3 環性の C_7-C_{15} 炭素芳香環基又は 5 若しくは 6 員の複素環基、若しくは窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれる複素原子を 1 環系当たり 1 ないし 5 個有する 2 ないし 3 環性の縮合複素芳香環基（但し、5 若しくは 6 員の複素環基を除く。）、 n は 0-2 の整数を示す。] で表される化合物又はその医薬上許容される塩。

2. R^1 及び R^2 が、共に水素原子である請求項 1 に記載の化合物。
3. R^3 が、 C_2-C_6 アルキル基（但し、 n -ブチル基は除く）である請求項 1 に記載の化合物。
4. R^4 が、水素原子又は C_1-C_3 アルキル基である請求項 1 に記載の化合物。
5. R^5 において、炭素芳香環基が、フェニル基、ナフチル基であり、置換基を有していてもよい炭素芳香環基の置換基が、水素原子、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシ基、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、環状の飽和若しくは不飽和の C_3-C_9 脂肪族基、アラルキル基、 N -アラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、 N -アラルキルカルバモイル基、アリール基、 N -アリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、 N -アリールスルホニルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、アリールスルファモイル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、アリールスルファモイル C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、 N -アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、 N -アロイル基、 C_2-C_6 アルカノイル基、 C_2-C_6 アルカノイルオキシ基、 $N-C_2-C_6$ アルカノイルアミノ基、 N 、 N -ジ- C_2-C_6 アルカノイルアミノ基、 $N-C_1-C_6$ アルキルアミノ基、 $N-C_1-C_{10}$ アルキ

ルカルバモイル基、N, N-ジ- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、N-アミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボニル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、N- C_3-C_6 シクロアルキルアミノ基、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ基、N- C_3-C_6 シクロアルキルカルバモイル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、
 10 ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基、モルホリノ基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、アクリジニル基、イソキノリル
 15 基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリル基、クロマニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、ベンゾイミダゾ
 20 リル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基、ジヒドロベンゾフラニル基、メチレンジオキシフェニル基であり、1ないし3環性の C_7-C_{15} 炭素芳香環基が、アセナフチレニル基、アダマンチル基、アンスリル基、インデニル基、フェナンスリル基であり、5若しくは6員の複素環基が、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、
 25 オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基であり、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれる複素原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の複素芳香環基（5又は6員の複素環基を除く。）が、アクリジニル基

- 、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリル基、クロマニル基、イソクロマニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリジニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、チオナフテニル基、ナフチジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、フェノチアジニル基、フタラジニル基、プテリジニル基、プリニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基、ジヒドロベンゾフラニル基若しくはメチレンジオキシフェニル基である請求項1に記載の化合物。
- 5 6. Arにおいて、炭素芳香環基が、フェニル基、ナフチル基であり、置換基を有していてもよい炭素芳香環基の置換基が、水素原子、アジド基、アミノ基、カルバモイル基、カルバモイルアミノ基、カルバモイルオキシ基、カルボキシル基、シアノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、環状の飽和若しくは不飽和の C_3-C_9 脂肪族基、アラルキル基、N-アラルキルアミノ基、アラルキルオキシ基、アラルキルカルボニル基、N-アラルキルカルバモイル基、アリール基、N-アリールアミノ基、アリールオキシ基、アリールスルホニル基、アリールスルホニルオキシ基、N-アリールスルホニルアミノ C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アリールスルファモイル基、アリールスルファモイルオキシ基、アリールスルファモイル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、アリールスルファモイル C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、N-アリールカルバモイル基、アロイル基、アロキシ基、N-アロイル基、 C_2-C_6 アルカノイル基、 C_2-C_6 アルカノイルオキシ基、N- C_2-C_6 アルカノイルアミノ基、N, N-ジ- C_2-C_6 アルカノイルアミノ基、N- C_1-C_6 アルキルアミノ基、N- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N, N-ジ- C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、N, N-ジ- C_2-C_6 アルケニルカルバモイル基、N-アミノ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、N- C_1-C_6 アルコキシカルボニル C_1-C_{10} アルキルカルバモイル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシカルボニル基、アミノ C_1-C_6 アルコキシ
- 10
- 15
- 20
- 25

- カルボニル基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルアミノ基、 C_3-C_6 シクロアルキルオキシ基、 $N-C_3-C_6$ シクロアルキルカルバモイル基、イミダゾリジニル基、イミダゾリニル基、テトラヒドロフラニル基、ピラゾリジニル基、ピラゾリニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、ピロリジニル基、ピロリニル基、モルホリノ基、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、トリアゾリル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基、アクリジニル基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリル基、クロマニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、シンノリニル基、チオナフテニル基、ナフチリジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基、ジヒドロベンゾフラニル基、メチレンジオキシフェニル基であり、1ないし3環性の C_7-C_{15} 炭素芳香環基が、アセナフチレニル基、アダマンチル基、アンスリル基、インデニル基、フェナンスリル基であり、5若しくは6員の複素環基が、イソオキサゾリル基、イソチアゾリル基、イミダゾリル基、オキサゾリル基、チアゾリル基、チアジアゾリル基、チエニル基、ピリジル基、ピラジニル基、ピリミジニル基、ピリダジニル基、ピラゾリル基、ピロリル基、ピラニル基、フリル基であり、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子からなる群より選ばれる複素原子を1環系当たり1ないし5個有する1ないし3環性の縮合複素芳香環基（5若しくは6員の複素環基を除く。）が、アクリジニル基、イソキノリル基、イソインドリル基、インダゾリル基、インドリル基、インドリジニル基、エチレンジオキシフェニル基、カルバゾリル基、キナゾリニル基、キノキサリニル基、キノリル基、クロマニル基、イソクロマニル基、クロメニル基、フェナンスリジニル基、フェナンスロリジニル基、ジベンゾフラニル基、ジベンゾチオフェニル基、チオナフテニル基、ナフチジニル基、フェナジニル基、フェナキサジニル基、フェノチアジニル基、フトラジニル基、プテリジニル基、プリ

ニル基、ベンゾイミダゾリル基、ベンゾオキサゾリル基、ベンゾチアゾリル基、ベンゾトリアゾリル基、ベンゾフラニル基、ジヒドロベンゾフラニル基若しくはメチレンジオキシフェニル基である請求項 1 に記載の化合物。

7. n が、0 又は 2 である請求項 1 に記載の化合物。